



19 BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

12 Offenlegungsschrift
10 DE 195 09 079 A 1

51 Int. Cl.⁶:
A 61 K 7/00
A 61 K 7/38
A 61 K 9/113

23

21 Aktenzeichen: 195 09 079.9
22 Anmeldetag: 15. 3. 95
43 Offenlegungstag: 19. 9. 96

DE 195 09 079 A 1

71 Anmelder:
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

72 Erfinder:
Schreiber, Jörg, Dr., 22087 Hamburg, DE; Klier,
Manfred, Dr., 21521 Aumühle, DE; Wolf, Florian, Dr.,
20251 Hamburg, DE; Eitrich, Anja, 22587 Hamburg,
DE; Gohla, Sven, Dr., 21007 Hamburg, DE

56 Entgegenhaltungen:
US 52 83 056
US 41 46 499
WO 92 18 147 A1
JP 06-262060 A in: Patent Abstracts of Japan;
FÖRSTER, T., et al.: SÖFW-Journal, 118. Jahr- gang,
Nr. 10, 1992, S. 649;
STUPAR, M. und TUFEYDZİć, N.: Goldschmidt
informiert 1982, Bd. 57, S. 22-28;

Prüfungsantrag gem. § 44 PatG ist gestellt

54 Kosmetische oder dermatologische Mikroemulsionen

- 57 Transparente Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser,
- umfassend eine Ölphase und eine Wasserphase
 - enthaltend mindestens einen O/W-Emulgator
 - gewünschtenfalls enthaltend einen oder mehrere W/O-Emulgatoren
 - einen Emulgatorgehalt kleiner als 20 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Emulsion, aufweisend,
 - erhältlich auf die Weise, daß ein Gemisch aus den Grundkomponenten, umfassend Wasserphase, Ölphase, einen oder mehrere der erfindungsgemäßen O/W-Emulgatoren, gewünschtenfalls einen oder mehrere W/O-Emulgatoren, sowie gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe auf eine Temperatur innerhalb oder oberhalb des Phaseninversionstemperaturbereiches bringt, und hernach auf Raumtemperatur abkühlt,
 - wobei der O/W-Emulgator oder die O/W-Emulgatoren gewählt wird oder werden aus der Gruppe
 - der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen
 - der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
 - der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50,

- der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Ethoxylierungsgrad von 3 bis 100
- der Alkylethercarbonsäuren ...

DE 195 09 079 A 1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

BUNDESDRUCKEREI 07.96 602 038/115

15/26

BEST AVAILABLE COPY

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Mikroemulsionen, insbesondere solche Mikroemulsionen für kosmetische und dermatologische Zubereitungen. Als besondere Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung für kosmetische und medizinische Zwecke.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Medizinische topische Zusammensetzungen enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z. B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

Häufige Erscheinungsformen kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen sind feindisperse Mehrphasensysteme, in welchen eine oder mehrere Fett- bzw. Ölphasen neben einer bzw. mehreren Wasserphasen vorliegen. Von diesen Systemen sind wiederum die eigentlichen Emulsionen die am weitesten verbreiteten.

In einfachen Emulsionen liegen in der einen Phase feindisperse, von einer Emulgatorhülle umschlossene Tröpfchen der zweiten Phase (Wassertröpfchen in W/O- oder Lipidvesikel in O/W-Emulsionen) vor. Die Tröpfchendurchmesser der gewöhnlichen Emulsionen liegen im Bereich von ca. 1 µm bis ca. 50 µm. Solche "Makroemulsionen" sind, ohne weitere färbende Zusätze, milchigweißgefärbt und opak. Feinere "Makroemulsionen", deren Tröpfchendurchmesser im Bereich von ca. 10^{-1} µm bis ca. 1 µm liegen, sind, wiederum ohne färbende Zusätze, bläulichweißgefärbt und opak. Solche "Makroemulsionen" haben für gewöhnlich hohe Viskosität.

Mizellaren und molekularen Lösungen mit Partikeldurchmessern kleiner als ca. 10^{-2} µm, die allerdings nicht mehr als echte Emulsionen aufzufassen sind, ist vorbehalten, klar und transparent zu erscheinen.

Der Tröpfchendurchmesser von Mikroemulsionen dagegen liegt im Bereich von etwa 10^{-2} µm bis etwa 10^{-1} µm. Mikroemulsionen sind transluzent und meist niedrigviskos. Die Viskosität vieler Mikroemulsionen vom O/W-Typ ist vergleichbar mit der des Wassers.

Vorteil von Mikroemulsionen ist, daß in der dispersen Phase Wirkstoffe feiner dispers vorliegen können als in der dispersen Phase von "Makroemulsionen". Ein weiterer Vorteil ist, daß sie aufgrund ihrer niedrigen Viskosität versprühbar sind. Werden Mikroemulsionen als Kosmetika verwendet, zeichnen sich entsprechende Pro-

dukte durch hohe kosmetische Eleganz aus.

Nachteilig an den Mikroemulsionen des Standes der Technik ist, daß stets ein hoher Gehalt an einem oder mehreren Emulgatoren eingesetzt werden muß, da die geringe Tröpfchengröße eine hohe Grenzfläche zwischen den Phasen bedingt, welche in der Regel durch Emulgatoren stabilisiert werden muß.

An sich ist die Verwendung der üblichen kosmetischen Emulgatoren unbedenklich. Dennoch können Emulgatoren, wie letztlich jede chemische Substanz, im Einzelfalle allergische oder auf Überempfindlichkeit des Anwenders beruhende Reaktionen hervorrufen.

So ist bekannt, daß bestimmte Lichtdermatosen durch gewisse Emulgatoren, aber auch durch verschiedene Fette, und gleichzeitige Exposition von Sonnenlicht ausgelöst werden. Solche Lichtdermatosen werden auch "Mallorca-Akne" genannt. Eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung war daher, Sonnenschutzprodukte zu entwickeln.

So betrifft die vorliegende Erfindung als besondere Ausführungsformen kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen, insbesondere hautpflegende kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen.

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. Während Strahlen mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist (der sogenannte UVC-Bereich), von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert werden, verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UVB-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen.

Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

Zum Schutze gegen UVB-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich zumeist um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoösäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie auch des 2-Phenylbenzimidazols handelt.

Auch für den Bereich zwischen etwa 320 nm und etwa 400 nm, den sogenannten UVA-Bereich, ist es wichtig, Filtersubstanzen zur Verfügung zu haben, da auch dessen Strahlen Schäden hervorrufen können. So ist erwiesen, daß UVA-Strahlung zu einer Schädigung der elastischen und kollagenen Fasern des Bindegewebes führt, was die Haut vorzeitig altern läßt, und daß sie als Ursache zahlreicher phototoxischer und photoallergischer Reaktionen zu sehen ist. Der schädigende Einfluß der UVB-Strahlung kann durch UVA-Strahlung verstärkt werden.

Die UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen.

Um diesen Reaktionen vorzubeugen, können den kosmetischen bzw. dermatologischen Formulierungen zusätzlich Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden.

UV-Absorber bzw. UV-Reflektoren sind die meisten anorganischen Pigmente, die bekannterweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen.

Wegen der guten Versprühbarkeit eignen sich Mi-

kre-emulsionen auch für andere kosmetische dermatologische Anwendungen, beispielsweise Desodorantien, so daß die vorliegende Erfindung in einer besonderen Ausführungsform Mikroemulsionen als Grundlage für kosmetische Desodorantien betrifft.

Kosmetische Desodorantien dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich geruchlose frische Schweiß durch Mikroorganismen zersetzt wird. Den üblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstringentien — vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) — die Bildung des Schweißes reduziert werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflusst; im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

- 1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.
- 2) Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.
- 3) Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

Die herkömmlichen Zubereitungen in Emulsionsform sind zwar im allgemeinen gut wirksam, zeichnen sich aber nur bedingt durch Pflegewirkung aus. Auch die Verwendung von Mikroemulsionen als Grundlage für desodorierende oder antitranspirant wirkende Zubereitungen sind bekannt. Deren relativ hoher Gehalt an Emulgatoren, mit den geschilderten Nachteilen, war bisher ein Übelstand, dem es abzuhelpen galt.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, Zubereitungen zu entwickeln, welche als Grundlage für kosmetische Desodorantien bzw. Antitranspirantien geeignet sind, und die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Grundlagen für kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen.

Ferner war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Produkte auf der Basis von Mikroemulsionen mit einer möglichst breiten Anwendungsvielfalt zur Verfügung zu stellen. Beispielsweise sollten Grundlagen für Zubereitungsformen wie Reinigungsemulsionen, Gesichts- und Körperpflegezubereitungen, aber auch ausgesprochen medizinischpharmazeutische Darreichungsformen ge-

schaffen werden, zum Beispiel Zubereitungen gegen Akne und andere Hauterscheinungen. Schließlich sollte auch grundsätzlich der Weg zu innerlich anwendbaren Emulsionen, beispielsweise für die parenterale Ernährung durch die vorliegende Erfindung eröffnet werden.

Eine besondere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, feindisperse Zubereitungen vom Typ Öl-in-Wasser mit einem möglichst niedrigen Emulgatorgehalt zur Verfügung zu stellen, welche nicht die Nachteile des Standes der Technik aufweisen und welche für verschiedenste kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen, beispielsweise die vorab beschriebenen Verwendungen finden können. Eine weitere Aufgabe der Erfindung war, das begrenzte Angebot an feindispersen Zubereitungen vom Typ Öl-in-Wasser des Standes der Technik zu bereichern.

Es ist an sich bekannt, daß hydrophile Emulgatoren bei steigender Temperatur ihr Löslichkeitsverhalten von wasserlöslich zu fettlöslich ändern. Der Temperaturbereich, in dem die Emulgatoren ihre Löslichkeit ändern, wird Phaseninversionstemperaturbereich genannt. Für den Phaseninversionstemperaturbereich soll innerhalb dieser Schrift auch die Abkürzung "PIT" gebraucht werden.

Die Änderung dieses Löslichkeitsverhaltens äußert sich bekanntermaßen darin, daß eine Mischung aus Wasser, Öl und O/W-Emulgatoren, welche unterhalb des PIT nach entsprechender Agitation eine O/W-Emulsion ergibt, auf eine Temperatur oberhalb des PIT gebracht wird, typischerweise etwa 70—80°C, als Zwischenstufe den Zustand einer Mikroemulsion durchläuft, um schließlich oberhalb des PIT eine W/O-Emulsion zu ergeben. Wird diese Emulsion abgekühlt, wird wieder eine O/W-Emulsion erhalten, welche aber eine Tröpfchengröße kleiner als 100 nm besitzt, also eine Mikroemulsion darstellt.

Auf solche Weise hergestellte Mikroemulsionen des Standes der Technik haben allerdings den Nachteil, daß erstens die Tröpfchengröße immer noch recht hoch ist und zweitens immer noch ein hoher Anteil an einem oder mehreren Emulgatoren nötig ist.

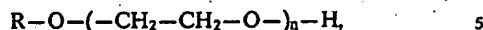
Weiterhin ist nachteilig, daß auf solche Weise hergestellte Mikroemulsionen zwar bei hoher Temperatur, also beispielsweise im PIT, praktisch transparent sind, aber beim Absinken auf Raumtemperatur wieder transluzent oder opak werden.

Auch diesen Übelständen galt es also, abzuhelpen.

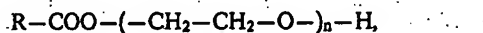
Erstaunlicherweise werden all diese Aufgaben gelöst durch transparente Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser,

- umfassend eine Ölphase und eine Wasserphase
- enthaltend mindestens einen O/W-Emulgator
- gewünschtenfalls enthaltend einen oder mehrere W/O-Emulgatoren
- einen Emulgatorgehalt kleiner als 20 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Emulsion, aufweisend,
- erhältlich auf die Weise, daß ein Gemisch aus den Grundkomponenten, umfassend Wasserphase, Ölphase, einen oder mehrere der erfindungsgemäßen O/W-Emulgatoren, gewünschtenfalls einen oder mehrere W/O-Emulgatoren, sowie gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe auf eine Temperatur innerhalb oder oberhalb des Phaseninversionstemperaturbereiches bringt, und hernach auf Raumtemperatur abkühlt,
- wobei der O/W-Emulgator oder die O/W-Emul-

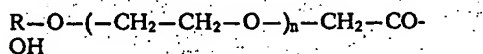
gatoren gewählt wird oder werden aus der Gruppe
— der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel



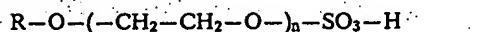
wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen
— der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel 10



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50,
— der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Ethoxylierungsgrad von 3 bis 100
— der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel 20 25



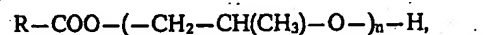
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel 35



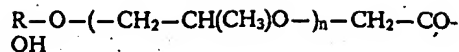
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel 45



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel 55



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Polypropylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Propoxylierungsgrad zwischen 3 und 50
— der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100
— der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel 65



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel



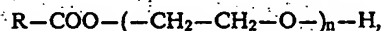
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Zuckerester
— der Dimethiconcopolyole.

Insbesondere ist vorteilhaft, wenn der O/W-Emulgator oder die O/W-Emulgatoren gewählt wird oder werden aus der Gruppe

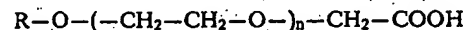
— der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5—30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen
— der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5—30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren mit 6 bis 26 C-Atomen und einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50
— der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Ethoxylierungsgrad von 3 bis 100
— der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel



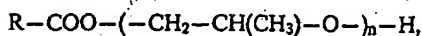
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5—30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5—30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen
— der Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,

— der Polypropylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren mit 6 bis 26 C-Atomen und einem Propoxylierungsgrad zwischen 3 und 50

— der ethoxiierten Sorbitanester mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100

— der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen.

Es ist von Vorteil, die Fettalkoholethoxylate aus der Gruppe der ethoxiierten Stearylalkohole, Cetylalkohole, Cetylstearylalkohole (Cetearylalkohole) zu wählen. Insbesondere bevorzugt sind Polyethylenglycol(16)stearylether (Stearth-16), Polyethylenglycol(15)cetylstearylether (Cetearth-15), Polyethylenglycol(15)cetyllether (Ceteth-15).

Es ist ferner von Vorteil, die Fettsäureethoxylate aus der Gruppe Polyethylenglycol(14)stearat und Polyethylenglycol(12)stearat zu wählen.

Weiterhin ist von Vorteil, die Polyethylenglycolglycerinfettsäureester aus der Gruppe Polyethylenglycol(15)glyceryllaurat, Polyethylenglycol(7)glycerylcococaprat, Polyethylenglycol(6)glycerylcaprat, Polyethylenglycol(12)glyceryllaurat zu wählen.

Es ist ebenfalls günstig, die Sorbitanester aus der Gruppe Polyethylenglycol(5)sorbitanisostearat, Polyethylenglycol(10)sorbitanlaurat zu wählen.

Schließlich ist vorteilhaft, als Zuckerester das Saccharosestearat zu wählen.

Als fakultative, dennoch erfindungsgemäß vorteilhafte W/O-Emulgatoren können eingesetzt werden: Monoglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Diglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8

bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Monoglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkohole einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Diglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkohole einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkohole einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Propylenglycolester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen sowie Sorbitanester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt, Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(-CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt, Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(-CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt, Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(-CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt.

Insbesondere vorteilhafte W/O-Emulgatoren sind Glycerylmonostearat, Glycerylmonoisostearat, Glycerylmonomyristat, Glycerylmonooleat, Diglycerylmonostearat, Diglycerylmonoisostearat, Propylenglycolmonostearat, Propylenglycolmonoisostearat, Propylenglycolmonocaprylat, Propylenglycolmonolaurat, Sorbitanmonoisostearat, Sorbitanmonolaurat, Sorbitanmonocaprylat, Sorbitanmonoisoleat, Saccharosedistearat, Behenylalkohol, Isobehenylalkohol, Selachylalkohol, Chmylalkohol, Polyethylenglycol(2)stearylether (Stearth-2).

Es ist erfindungsgemäß möglich, den Gesamtgehalt an Emulgatoren kleiner als 15 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Mikroemulsion, zu halten. Es wird bevorzugt, den Gesamtgehalt an Emulgatoren kleiner als 10 Gew.-%, insbesondere kleiner als 8 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Mikroemulsion, zu halten.

Die Ölphase der erfindungsgemäßen Mikroemulsionen wird bevorzugt gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen, aus der Gruppe der gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen, der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen, sowie aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkane.

Vorzugsweise wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Iseicosan, 2-Ethylhexylcocoat,

C₁₂-15-Alkybenzoat.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂-15-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂-15-Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂-15-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen, wobei bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an den anderen vorgenannten Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotrisiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt.

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Die Herstellung der erfindungsgemäßen Mikroemulsionen erfolgt bevorzugt auf die Weise, daß ein Gemisch aus den Grundkomponenten, umfassend Wasserphase, Ölphase, einen oder mehrere der erfindungsgemäßen O/W-Emulgatoren, gewünschtenfalls einen oder mehrere W/O-Emulgatoren, sowie gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe, welche unterhalb des Phaseninversionstemperaturbereiches eine O/W-Emulsion bilden, auf eine Temperatur oberhalb oder innerhalb des Phaseninversionstemperaturbereiches bringt, und die gebildete Mikroemulsion hernach auf Raumtemperatur abkühlt.

Dies geschieht bevorzugt unter Rühren. Erstaunlicherweise ist es möglich, auf einen Homogenisierungsschritt zu verzichten.

Der Zusatz von Elektrolyten bewirkt eine Veränderung des Löslichkeitsverhaltens eines hydrophilen Emulgators. Die hydrophilen Emulgatoren mit den vorab beschriebenen Strukturen bzw. Eigenschaften durchlaufen eine partielle Phaseninversion, in der es zu einer Solubilisierung von Wasser durch die Ölphase kommt, welche in einer stabilen Mikroemulsion resultiert.

Die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen enthalten daher vorteilhaft Elektrolyte, insbesondere eines oder mehrere Salze mit folgenden Anionen: Chloride, ferner anorganische Oxo-Element-Anionen, von diesen insbesondere Sulfate, Carbonate, Phosphate, Borate und Aluminate. Auch auf organischen Anionen basierende Elektrolyte können vorteilhaft verwendet werden, beispielsweise Lactate, Acetate, Benzoate, Propionate, Tartrate, Citrate und andere mehr. Vergleichbare Effekte sind auch durch Ethylen-diamintetraessigsäure und deren Salze zu erzielen.

Als Kationen der Salze werden bevorzugt Ammonium-, Alkylammonium-, Alkalimetall-, Erdalkalimetall-, Magnesium-, Eisen- bzw. Zinkionen verwendet. Es bedarf an sich keiner Erwähnung, daß in Kosmetika nur physiologisch unbedenkliche Elektrolyte verwendet werden sollten. Spezielle medizinische Anwendungen der erfindungsgemäßen Mikroemulsionen können andererseits, wenigstens grundsätzlich, die Verwendung von Elektrolyten bedingen, welche nicht ohne ärztliche Aufsicht verwendet werden sollten.

Besonders bevorzugt sind Kaliumchlorid, Kochsalz, Magnesiumsulfat, Zinksulfat und Mischungen daraus. Ebenfalls vorteilhaft sind Salzmischungen wie sie im natürlichen Salz vom Toten Meer auftreten.

Die Konzentration des oder der Elektrolyte sollte etwa 0,1–10,0 Gew.-%, besonders vorteilhaft etwa 0,3–8,0 Gew.-% betragen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Stellen die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen Grundlagen für kosmetische Desodorantien/Antitranspirantien dar, so können alle gängigen Wirkstoffe vorteilhaft genutzt werden, beispielsweise Geruchsüberdecker wie die gängigen Parfümbestandteile, Geruchsabsorber, beispielsweise die in der Patentoffenlegungsschrift DE-P 40 09 347 beschriebenen Schichtsilikate, von diesen insbesondere Montmorillonit, Kaolinit, Illit, Beidellit, Nontronit, Saponit, Hectorit, Bentonit, Smectit, ferner beispielsweise Zinksalze der Ricinolsäure. Keimhemmende Mittel sind ebenfalls geeignet, in die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen eingearbeitet zu werden. Vorteilhafte Substanzen sind zum Beispiel 2,4,4'-Trichlor-2'-hydroxydiphenylether (Irgasan), 1,6-Di-(4-chlorphenylbiguanido)-hexan (Chlorhexidin), 3,4,4'-Trichlorcarbanilid, quaternäre Ammoniumverbindungen, Nelkenöl, Minzöl, Thymianöl, Triethylcitrat, Farnesol (3,7,11-Trimethyl-2,6,10-dodecatrien-1-ol) sowie die in den Patentoffenlegungsschriften DE 37 40 186, DE-39 38 140, DE-42 04 321, DE-42 29 707, DE-42 29 737, DE-42 37 081, DE-43 09 372, DE-43 24 219 beschriebenen wirksamen Agenzien.

Die üblichen Antitranspiranswirkstoffe können ebenfalls vorteilhaft in den erfindungsgemäßen Mikroemulsionen verwendet werden, insbesondere Adstringentien, beispielsweise basische Aluminiumchloride.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen Desodorantien können in Form von Aerosolen, also aus Aerosolbehältern, Quetschflaschen oder durch eine Pumpvorrichtung versprühbaren Präparaten vorliegen oder in Form von mittels Roll-on-Vorrichtungen auftragbaren flüssigen Zusammensetzungen, jedoch auch in Form von aus normalen Flaschen und Behältern auftragbaren Mikroemulsionen.

Als Treibmittel für erfindungsgemäße, aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische Desodorantien sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüchtigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen zusätzlich mindestens eine UVA-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UVB-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlich Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescrèmes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische und/oder dermatologische Zu-

bereitungen zur Verfügung zu stellen, die die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel dienen.

Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z. B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z. B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoessäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoessäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoessäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Triänilino(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z. B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze,
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencampfers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Gegenstand der Erfindung ist auch die Kombination eines erfindungsgemäßen UVA-Filters mit einem UVB-Filter bzw. eine erfindungsgemäße kosmetische oder dermatologische Zubereitung, welche auch einen UVB-Filter enthält.

Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

Erfindungsgemäße kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt

handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Eine erstaunliche Eigenschaft der vorliegenden Erfindung ist, daß erfindungsgemäße Zubereitungen sehr gute Vehikel für kosmetische oder dermatologische Wirkstoffe in die Haut sind, wobei vorteilhafte Wirkstoffe Antioxidantien sind, welche die Haut vor oxidativer Beanspruchung schützen können.

Erfindungsgemäß enthalten die Zubereitungen vorteilhaft eines oder mehrere Antioxidantien. Als günstige, aber dennoch fakultativ zu verwendende Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden. Es ist dabei vorteilhaft, Antioxidantien als einzige Wirkstoffklasse zu verwenden, etwa dann, wenn eine kosmetische oder dermatologische Anwendung im Vordergrund steht wie die Bekämpfung der oxidativen Beanspruchung der Haut. Es ist aber auch günstig, die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen mit einem Gehalt an einem oder mehreren Antioxidantien zu versehen, wenn die Zubereitungen einem anderen Zwecke dienen sollen, z. B. als Desodorantien oder Sonnenschutzmittel.

Besonders vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, gamma-Linoleyl-, Cholesteryl- und Glyceryl-ester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteininsulfoximin, Buthioninsulfone, Pöntat-, Hexa-, Heptahioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z. B. Zitronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Galleneextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. gamma-Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitate, Mg-Ascorbylphosphate, Ascorbylacetate), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharztes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Hamsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung können öllösliche Antioxidantien eingesetzt werden.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05—20 Gew.-%, insbesondere 1—10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001—10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001—10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zubereitungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

Erfindungsgemäß können Wirkstoffe auch sehr vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der lipophilen Wirkstoffe, insbesondere aus folgender Gruppe:

Acetylsalicylsäure, Atropin, Azulen, Hydrocortison und dessen Derivate, z. B. Hydrocortison-17-valerat, Vitamine, z. B. Ascorbinsäure und deren Derivate, Vitamine der B- und D-Reihe, sehr günstig das Vitamin B₁, das Vitamin B₁₂, das Vitamin D₁, aber auch Bisabolol, ungesättigte Fettsäuren, namentlich die essentiellen Fettsäuren (oft auch Vitamin F genannt), insbesondere die gamma-Linolensäure, Ölsäure, Eicosapentaensäure, Docosahexaensäure und deren Derivate, Chloramphenicol, Coffein, Prostaglandine, Thymol, Campher, Extrakte oder andere Produkte pflanzlicher und tierischer Herkunft, z. B. Nachtkerzenöl, Borretschöl oder Johanniskernöl, Fischöle, Lebertran aber auch Ceramide und ceramidähnliche Verbindungen und so weiter.

Obgleich selbstverständlich auch die Verwendung hydrophiler Wirkstoffe erfindungsgemäß begünstigt ist, ist ein weiterer Vorteil der erfindungsgemäßen Mikroemulsionen, daß die hohe Anzahl feinstzerteilter Tröpfchen gerade öllösliche bzw. lipophile Wirkstoffe mit besonders großer Wirksamkeit biologisch verfügbar macht.

Vorteilhaft ist es auch, die Wirkstoffe aus der Gruppe der rückfettenden Substanzen zu wählen, beispielsweise Purcellinöl, Eucerit® und Neocerit®.

Entsprechend können die erfindungsgemäßen Zubereitungen, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzemulsion, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährlotion, Tages- oder Nacht-emulsion usw.

Die erfindungsgemäßen Mikroemulsionen tragen ferner in vorzüglicher Weise zur Hautglättung bei, insbesondere, wenn sie mit einer oder mehreren Substanzen versehen sind, die die Hautglättung fördern.

Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zubereitungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden. Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen. Die

Übergänge zwischen reinen Kosmetika und reinen Pharmaka sind dabei fließend. Als pharmazeutische Wirkstoffe sind erfindungsgemäß grundsätzlich alle Wirkstoffklassen geeignet, wobei lipophile Wirkstoffe bevorzugt sind. Beispiele sind: Antihistaminika, Antiphlogistika, Antibiotika, Antimykotika, die Durchblutung fördernde Wirkstoffe, Keratolytika, Hormone, Steroide, Vitamine usw.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Viruzide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, entzündungshemmende Substanzen, Medikamente, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel.

Insbesondere vorteilhaft werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet.

Als weitere Bestandteile können verwendet werden Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren, Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen.

Beispiel 1

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Glycerylisostearat	1,800
PEG-15-Cetylstearylalkohol	5,200
Sorbitol	2,900
Isotridecylisononanoat	10,000
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,883
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

15

Beispiel 2

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Glycerylisostearat	1,800
PEG-15-Cetylstearylalkohol	5,100
Octylisostearat	3,300
Cyclomethicon	6,600
Sorbitol	2,900
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,900
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

16

Beispiel 5

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Diglycerylmonoisostearat	1,800
PEG-15-Cetylstearylalkohol	5,100
C ₁₂₋₁₅ -Alkylbenzoat	5,000
Octylisostearat	5,000
Sorbitol	2,900
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,900
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

Beispiel 3

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Glycerylisostearat	1,800
PEG-17-Cetylstearylalkohol	5,200
Isotridecylisononanoat	3,300
Sorbitol	2,900
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,900
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

Beispiel 6

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Diglycerylmonoisostearat	2,300
PEG-15-Cetylstearylalkohol	4,600
Cyclomethicon	6,600
Sorbitol	2,900
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,900
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

Beispiel 4

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Sorbitanmonoisostearat	2,300
PEG-15-Cetylstearylalkohol	4,600
Sorbitol	2,900
Cyclomethicon	6,600
Sorbitol	2,900
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,900
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

Beispiel 7

Desodorierende Zubereitung

	Gew.-%
Glycerylisostearat	1,800
PEG-16-Stearylalkohol	5,100
Octylisostearat	3,300
Cyclomethicon	6,600
Sorbitol	2,900
Glycerinmonocaprat	0,100
Aluminiumchlorhydrat	3,900
Parfum, Antioxidantien	q.s.
Wasser, ad	100,000

Beispiel 8

Desodorierende Zubereitung

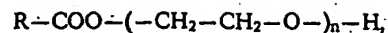
	Gew.-%	
Propylenglycolmonoisostearat	2,300	5
PEG-15-Cetylstearylalkohol	4,600	
Isotridecylisononanoat	3,300	
Cyclomethicon	6,600	
Sorbitol	2,900	
Glycerinmonocaprat	0,100	10
Aluminiumchlorhydrat	3,900	
Parfum, Antioxidantien	q.s.	
Wasser, ad	100,000	15

Beispiel 9

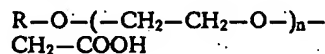
	Gew.-%	
Propylenglycolmonoisostearat	2,300	20
PEG-15-Cetylstearylalkohol	4,600	
Isotridecylisononanoat	3,300	
Cyclomethicon	6,600	
Sorbitol	2,900	
Parfum, Antioxidantien	q.s.	25
Wasser, ad	100,000	
		30

Patentansprüche

1. Transparente Mikroemulsionen vom Typ Öl-in-Wasser, 35
 - umfassend eine Ölphase und eine Wasserphase
 - enthaltend mindestens einen O/W-Emulgator
 - gewünschtenfalls enthaltend einen oder mehrere W/O-Emulgatoren
 - einen Emulgatorgehalt kleiner als 20 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Emulsion, aufweisend,
 - erhältlich auf die Weise, daß ein Gemisch aus den Grundkomponenten, umfassend Wasserphase, Ölphase, einen oder mehrere der erfindungsgemäßen O/W-Emulgatoren, gewünschtenfalls einen oder mehrere W/O-Emulgatoren, sowie gewünschtenfalls weitere Hilfs-, Zusatz- und/oder Wirkstoffe auf eine Temperatur innerhalb oder oberhalb des Phaseninversionstemperaturbereiches bringt, und hernach auf Raumtemperatur abkühlt,
 - wobei der O/W-Emulgator oder die O/W-Emulgatoren gewählt wird oder werden aus der Gruppe
 - der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel 60
2. wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen 65
 - der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
 — der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50,
 — der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Ethoxylierungsgrad von 3 bis 100
 — der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel



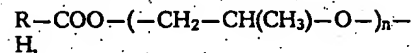
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
 — der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel



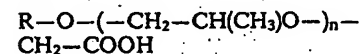
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
 — der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
 — der Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel

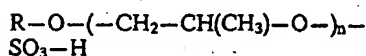


wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
 — der Polypropylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren und einem Propoxylierungsgrad zwischen 3 und 50
 — der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100
 — der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,

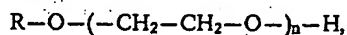
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel



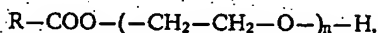
bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Zuckerester
— der Dimethiconcopolyole.

2. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der O/W-Emulgator oder die O/W-Emulgatoren gewählt wird oder werden aus der Gruppe

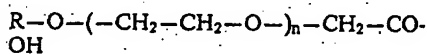
— der Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel



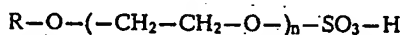
wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen
— der Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren mit 6 bis 26 C-Atomen und einem Ethoxylierungsgrad zwischen 3 und 50
— der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Ethoxylierungsgrad von 3 bis 100
— der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel

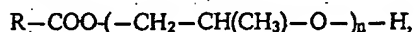


bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel

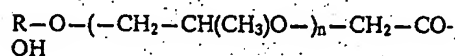


wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen

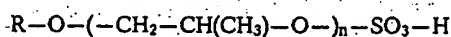
men und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen
— der Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel



wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Polypropylenglycolglycerinfettsäureester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Fettsäuren mit 6 bis 26 C-Atomen und einem Propoxylierungsgrad zwischen 3 und 50
— der ethoxylierten Sorbitanester mit einem Propoxylierungsgrad von 3 bis 100
— der Alkylethercarbonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen,
— der Alkylethersulfonsäuren der allgemeinen Formel



bzw. deren kosmetisch oder pharmazeutisch akzeptablen Salze, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest mit 5–30 C-Atomen und n eine Zahl von 10 bis 20 darstellen.

3. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Fettalkoholethoxylate gewählt werden aus der Gruppe der ethoxylierten Stearylalkohole, Cetylalkohole, Cetylstearylalkohole (Cetearylalkohole) zu wählen. Insbesondere bevorzugt sind Polyethylenglycol(16)stearylether (Steareth-16), Polyethylenglycol(15)cetylstearylether (Cetareth-15), Polyethylenglycol(15)cetyllether (Ceteth-15).

4. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Fettsäureethoxylate gewählt werden aus der Gruppe Polyethylenglycol(14)stearat und Polyethylenglycol(12)stearat.

5. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Polyethylenglycolglycerinfettsäureester gewählt werden aus der Gruppe Polyethylenglycol(15)glyceryllaurat, Polyethylenglycol(7)glycerylcocoat, Polyethylenglycol(6)glycerylcaprat, Polyethylenglycol(12)glyceryllaurat.

6. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Sorbitanester gewählt werden aus der Gruppe Polyethylenglycol(5)sorbitanistearat, Polyethylenglycol(10)sorbitanlaurat.

7. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß als Zuckerester das Saccharosestearat gewählt wird.

8. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß als W/O-Emulgatoren eingesetzt werden: Monoglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkylcarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24,

insbesondere 12–18 C-Atomen, Diglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Propylenglycolester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen sowie Sorbitanester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12–18 C-Atomen, Fettalkoholethoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt, Fettsäureethoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH_2-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt, Fettalkoholpropoxylate der allgemeinen Formel $R-O-(CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt, Fettsäurepropoxylate der allgemeinen Formel $R-COO-(CH_2-CH(CH_3)-O)_n-H$, wobei R einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest und n eine Zahl von 1 bis 9 darstellt.

9. Mikroemulsionen nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß die W/O-Emulgatoren gewählt werden aus der Gruppe Glycerylmonostearat, Glycerylmonoisostearat, Glycerylmonomyristat, Glycerylmonooleat, Diglycerylmonostearat, Diglycerylmonoisostearat, Propylenglycolmonostearat, Propylenglycolmonoisostearat, Propylenglycolmonocaprylat, Propylenglycolmonolaurat, Sorbitanmonoisostearat, Sorbitanmonolaurat, Sorbitanmonocaprylat, Sorbitanmonoisooleat, Saccharose-disearat.

10. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Ölphase gewählt wird aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen, aus der Gruppe der gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen, der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 12 bis 25 C-Atomen, sowie aus der Gruppe der verzweigten Alkane und daß die Ölphase gewünschtenfalls einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweist.

11. Mikroemulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Ölphase gewählt wird aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Iseicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C_{12-15} -Alkybenzoat und gewünschtenfalls zusätzlich Cyclomethicon enthält.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.